

|                                                   |                                            |
|---------------------------------------------------|--------------------------------------------|
| SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO          |                                            |
| RAD: 11-64157- -13                                | FECHA: 2013-06-20 17:47:30                 |
| DEP: 2020 DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES          | EVE: 378 FASE NACIONAL INCLUIDO CAPITULO I |
| TRA: 11 PCT-PATENTE DE INVENCION CAPITULOS I Y II | FOLIOS: 5                                  |
| ACT: 519 PRESENTACION                             |                                            |

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

2020  
Bogotá, D.C.,  
  
Abogado(a)/Señor(a)  
CARLOS REINALDO OLARTE GARCIA

Asunto:        Radicación:        11-64157- -13  
                 Trámite:                11  
                 Evento:                378  
                 Actuación:                519  
                 Oficio:                        10778  
                 Folios:                        5

|                                     |                   |            |   |                               |  |
|-------------------------------------|-------------------|------------|---|-------------------------------|--|
| Patente de Invención                | X                 |            |   | Patente de Modelo de Utilidad |  |
| Vía Nacional                        |                   |            |   |                               |  |
| Vía PCT (Fase Nacional)             | X                 | Capítulo I | X | Capítulo II                   |  |
| No. Solicitud Internacional         | PCT/IB2009/055232 |            |   |                               |  |
| Fecha de Presentación Internacional | 20/11/2009        |            |   |                               |  |

Mediante Oficio N° 21361 notificado por fijación en lista de fecha 27 de noviembre de 2012, este Despacho requirió al doctor Carlos Reinaldo Olarte García en los términos del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, para que dentro del plazo de sesenta días presentara respuesta a las observaciones de carácter técnico, relacionadas con la patentabilidad o cumplimiento de los requisitos establecidos por esta Decisión, para la concesión de la patente que se tramita dentro del expediente de la referencia.

Teniendo en cuenta que mediante Resolución N° 15173 del 05 de abril de 2013, se revocó la Resolución N° 1732 del 28 de enero de 2013, por medio de la cual se concedió de manera equivocada la patente solicitada, sin que se hubiese vencido el término para atender el requerimiento de fondo contenido en el Oficio 21361 antes mencionado, considera este Despacho procedente efectuar un nuevo requerimiento de fondo con fundamento en lo dispuesto por el artículo 45 de la Decisión 486 y de esta manera continuar con el trámite de la solicitud, conforme se ha dispuesto en el referido acto administrativo.

## 1. Documentos estudiados

|                   |                                   |            |
|-------------------|-----------------------------------|------------|
| Descripción:      | Radicado No. 11-064157-00000-0000 | 24/05/2011 |
| Reivindicaciones: | Radicado No. 11-064157-00000-0000 | 24/05/2011 |
|                   | Radicado No. 11-064157-00004-0000 | 12/09/2011 |
| Prioridad:        | US 61/118,053                     | 26/11/2008 |

## 2. Análisis de la Prioridad

Se acepta la reivindicación de Prioridad porque esta solicitud fue presentada dentro del plazo establecido (Art. 9 D 486), y su contenido técnico corresponde con el de la prioridad reivindicada.

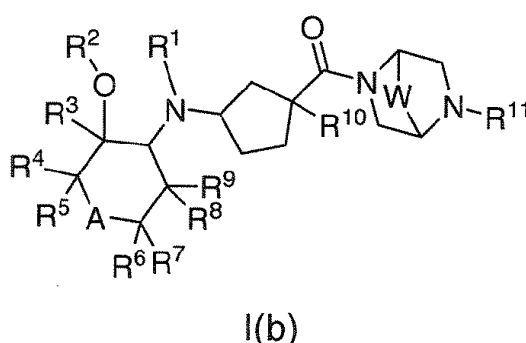
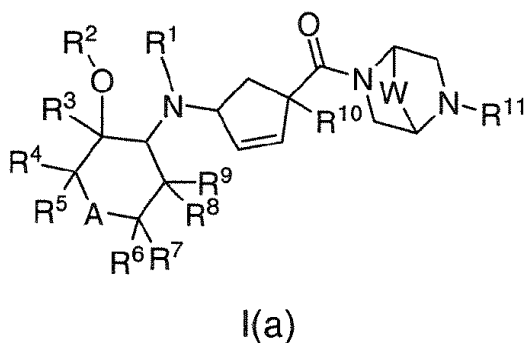
## 3. Objeto de la invención

De acuerdo con lo establecido en el numeral 1.2.2.2 del capítulo primero del Título 10 de la Circular Única para efectos del examen de patentabilidad, se tendrá en cuenta la tasa pagada por el solicitante al momento de comenzar el examen para las reivindicaciones adicionales; esto es que cuando la solicitud contenga más de diez (10) reivindicaciones y no se haya pagado la tasa complementaria, sólo se estudiarán las cubiertas por la tasa pagada. En el caso de la presente solicitud se estudiarán las reivindicaciones 1 a 12 .

Título de la solicitud: “3-AMINOCICLOPENTANCARBOXAMIDAS”

El problema planteado en esta solicitud consiste en suministrar compuestos útiles como moduladores de los receptores de quimioquinas CCR2 o CCR5 para el tratamiento de enfermedades autoinmunes

Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona derivados de las fórmulas I(a) o I(b).



El objeto de la presente Solicitud se relaciona con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP): A61K31/407; A61P29/02; A61P35/00; C07D487/08.

#### 4. De la Solicitud de Patente

##### Reivindicaciones (Art 30 D 486, Art 22 PCT)

La reivindicación 1 carece de concisión debido a que los radicales presentes en las fórmulas I(a) y I(b) abarcan un elevado número de sustituyentes los cuales presentan una gran variabilidad estructural, por lo cual no es claro cómo se conserva la actividad de los compuestos reclamados a pesar de las complejas modificaciones propuestas, particularmente para los sustituyentes R<sup>2</sup> a R<sup>11</sup>. Con fundamento en los compuestos ejemplificados y ensayados en la descripción, se encuentra que lo sustituyentes preferidos corresponden a:

R1, R3, R4, R5, R6, R7, R8 y R9 son H.  
R2 es CH<sub>3</sub>.  
A es O.  
W es -CH<sub>2</sub>-, -CH(F)-, -CH(OH)-.

| R10                                  | R11                                                            |
|--------------------------------------|----------------------------------------------------------------|
| etil                                 | Piridina sustituida con CF <sub>3</sub> , F, CH <sub>3</sub>   |
| isopropil                            | Pirazina sustituida con CF <sub>3</sub> , F, CH <sub>3</sub>   |
| -CH <sub>2</sub> -CH(F) <sub>2</sub> | Piridazina sustituida con CF <sub>3</sub> , F, CH <sub>3</sub> |
| -CH <sub>2</sub> -C(F) <sub>3</sub>  | Pirimidina sustituida con CF <sub>3</sub> , F, CH <sub>3</sub> |
| Hidroxí-ciclobutil                   | Fenil sustituido con CF <sub>3</sub> , F, CH <sub>3</sub>      |
| Acetiloxi-ciclobutil                 |                                                                |
| -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> OH |                                                                |
| tetrahidrofuranil                    |                                                                |
| -CH(OH)(CF <sub>3</sub> )            |                                                                |

En consecuencia, se sugiere restringir la solicitud a una razonable generalización del tipo de compuestos que han sido sintetizados o probados, es decir, que se encuentran debidamente sustentados.

El término alcoxi cicloalquilo utilizado en R<sup>10</sup>, y arilo y heteroarilo utilizados para definir el sustituyente R<sup>11</sup> en la reivindicación 1, carecen de concisión y deben ser limitados con fundamento en los compuestos ejemplificados y ensayados.

#### 5. Determinación del Estado de la Técnica

El Estado de la Técnica se determinó con base en la fecha de presentación de la solicitud de prioridad: 26 de noviembre de 2008, y se encontraron los siguientes documentos que anticipan el objeto de esta solicitud:

| Item | Documento     | Título                                                                                                     | Fecha de Publicación |
|------|---------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------|
| D1   | WO2005/105092 | "3,3-DISUBSTITUTED<br>TETRAHYDROPYRANYL CYCLOPENTYL<br>AMIDE MODULATORS OF CHEMOKINE<br>RECEPTOR ACTIVITY" | 10/11/2005           |
| D2   | US2005234034  | "Bicyclic and bridged nitrogen<br>heterocycles"                                                            | 20/10/2005           |

D1<sup>1</sup> divulga derivados de amino ciclopentil carboxamida útiles en la prevención y tratamiento de desordenes inflamatorios e inmuno-regulatorios (resumen).

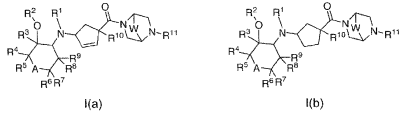
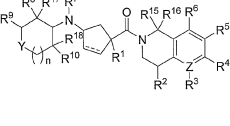
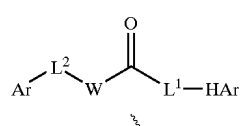
D2<sup>2</sup> enseña compuestos espirociclicos diamino útiles como moduladores del receptor de quimiocina CCR1, CCR2 o CCR3, los cuales tiene un sustituyente aril o heteroaril (resumen).

## 6. Examen de Patentabilidad (Art 14 D486)

### Nivel Inventivo (Art18 D486)

La reivindicación 1 consiste en un compuesto de las fórmulas I(a) o I(b).

Comparación de las características técnicas esenciales, con las del estado de la técnica:

| Características esenciales                                                                                                                                                                                                                                                                             | D1                                                                                                                                                                                                                                            | D2                                                                                                                                                             |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <p>Un compuesto de:</p>  <p>I(a) I(b)</p>                                                                                                                                                                             | <p>Derivados de:</p>                                                                                                                                         | <p>Derivados de:</p>  <p>W es<br/>L1 es un grupo ligante.<br/>(reiv. 1)</p> |
| R1 y R3 a R9 son H o alquil C <sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con F, alcoxi (C <sub>1-3</sub> ), OH, CN, COR <sup>12</sup>                                                                                                                                                                     | R <sup>7,8,9,10,18</sup> corresponden a H o alquil C <sub>1-6</sub> opcionalmente sustituido con halo, -O- (C <sub>1-3</sub> )alquil, OH, COR <sup>11</sup> . (Págs. 5 y 6)                                                                   | HAr es heteroaril sustituido. (reiv. 1)                                                                                                                        |
| R <sup>10</sup> alquilo (C <sub>1-6</sub> ), haloalquilo (C <sub>1-6</sub> ), hidroxialquilo (C <sub>1-6</sub> ), alcoxi (C <sub>1-6</sub> ), cicloalquilo(C <sub>3-6</sub> ), hidroxicicloalquilo (C <sub>1-3</sub> ), alcoxi cicloalquilo, OH, heterociclilo (C <sub>1-5</sub> ), amino, arilo o CN. | R <sup>1</sup> es alquilo (C <sub>1-6</sub> ) sustituido con halógeno, hidroxil; alquilo (C <sub>0-6</sub> )-cicloalquilo(C <sub>3-7</sub> )- alquilo (C <sub>0-6</sub> ), fenil, NR <sup>12</sup> R <sup>12</sup> . (Pág. 4, líneas 14 a 20) | no se menciona                                                                                                                                                 |
| R <sup>11</sup> arilo o heteroarilo opcionalmente sustituidos con alquilo (C <sub>1-6</sub> ), halo, haloalquilo (C <sub>1-6</sub> ) alcoxi (C <sub>1-6</sub> ), OH, amino, C(O)NH <sub>2</sub> , NH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> , SF <sub>5</sub> o CN.                                              | R <sup>3</sup> es alquil C1-3 sustituido con 1-3 F, -O-C1-3alquil, opcionalmente sustituido con 1-3F, hidroxil, cloro, bromo, fenil, heterociclo (Pág. 5, líneas 4 y 5)                                                                       | no se menciona                                                                                                                                                 |
| A es O o CF <sub>2</sub> .                                                                                                                                                                                                                                                                             | Y es -O- (Pág. 4, línea 9)                                                                                                                                                                                                                    | No se menciona                                                                                                                                                 |

El documento D1 se considera el estado de la técnica cercano a la invención definida en la reivindicación 1 porque divulga derivados de ciclopentil carboxamida sustituida con heterociclil, los cuales son útiles como moduladores del receptor de quimiocina para el tratamiento de enfermedades relacionadas.

1[ ][http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en\\_EP&FT=D&date=20051110&CC=WO&NR=2005105092A2&KC=A2](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?DB=EPODOC&II=0&ND=3&adjacent=true&locale=en_EP&FT=D&date=20051110&CC=WO&NR=2005105092A2&KC=A2)  
2[ ][http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=US&NR=2005234034A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20051020&DB=&locale=en\\_EP](http://worldwide.espacenet.com/publicationDetails/biblio?CC=US&NR=2005234034A1&KC=A1&FT=D&ND=&date=20051020&DB=&locale=en_EP)

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el producto de D1 consiste en que los compuestos de la presente solicitud presentan un anillo tipo espiro unido al carbonilo.

Por su parte, el documento D2 enseña compuestos espirociclo diamino útiles como moduladores del receptor de quimiocina (resumen).

La diferencia entre la invención, definida en la reivindicación 1 y el producto de D2 consiste en que la anterioridad no divulga en anillo ciclopentil unido al carbonilo.

El efecto que logra el incluir un anillo espirociclo sustituido es que permite obtener compuestos alternativos útiles como moduladores del receptor de quimiocina. Adicionalmente, los resultados presentados por el solicitante en la tabla 1 no son sorprendentes o inesperados ya que los valores de IC<sub>50</sub> para CCR2 se encuentran superpuestos al rango presentado por los compuestos divulgados en D1 frente al mismo receptor (pág. 66).

Por lo tanto, el Problema Técnico Objetivo que pretende resolver esta invención se puede formular así: ¿cómo modificar los compuestos conocidos en D1 para conseguir agentes alternativos moduladores de la actividad de los receptores de quimiocina?.

Sin embargo, la presencia de un anillo espirociclo unido al carbonilo para lograr compuestos moduladores del receptor de quimiocina ya está divulgada en el documento D2 que especifica la presencia de dicho anillo en el sustituyente denominado W (reiv. 1).

En consecuencia, el la persona del oficio normalmente versada en la materia, incluiría un anillo espirociclo como lo enseña D1 en sustitución del biciclo unido al carbonilo de D1 para llegar así al objeto de la reivindicación 1 de la solicitud. Por lo cual se considera obvia.

De manera que la solución propuesta por esta solicitud en la reivindicación 1 y sus dependientes 2-12, es obvia y no tiene Nivel Inventivo.

## 7. Conclusión

Los requisitos de Patentabilidad de la presente Solicitud están afectados así:

| Item | Documento     | Reivindicaciones afectadas | Requisito que afecta |
|------|---------------|----------------------------|----------------------|
| D1   | WO2005/105092 | 1-12                       | Nivel Inventivo      |
| D2   | US2005234034  | 1-12                       | Nivel Inventivo      |

En cumplimiento del artículo 45 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, se le indica que debe dar respuesta dentro del término de sesenta (60) días contados a partir de la fecha de notificación de la presente comunicación. En caso de no dar respuesta al presente requerimiento, o si a pesar de la respuesta subsistieran los impedimentos para la concesión, se denegará la patente.

Se invita al solicitante se sirva indicar, si así lo considera, su renuncia al término faltante de sesenta (60) días para dar respuesta a este requerimiento y presentarla por escrito.

Finalmente, se le recuerda al solicitante que si como respuesta a este requerimiento llegara a modificar el capítulo reivindicatorio y éste contenga más de diez (10) reivindicaciones, no pagará la tasa de modificación voluntaria pero sí la correspondiente al pago por reivindicación adicional.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No. 10 de 2001.



**JOSÉ LUIS SALAZAR LÓPEZ**  
Director de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista, de fecha 2013-06-25

Elaboró: Emilse Cano Urrego

Revisó: Lyna Del Carmen Mordecay Dunoyer